

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-90555- -5	FECHA: 2014-08-13 10:51:55
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 13-90555- -5
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 9939
 Folios: 5

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2011/053798				
Fecha de Presentación Internacional	29/09/2011				

Como resultado del examen de fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado No. 13-090555-00000-0000	8/abril/2013
Reivindicaciones:	Radicado No. 13-090555-00000-0000	8/abril/2013
	Radicado No. 13-090555-00003-0000	6/septiembre/2013
Prioridad:	US 61/389,911	10/octubre/2010

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Modificaciones aceptadas

Se acepta el nuevo capítulo reivindicatorio (13-090555-00003-0000) porque no se amplía el objeto de la solicitud.

4. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. En el presente caso, se tiene en cuenta la totalidad del nuevo capítulo reivindicatorio (13-090555-00003-0000) para el examen de patentabilidad.

Título de la solicitud: “((R)-(E)-2.(4-(2-(5-(1-(3,5-DICLOROPIRIDIN-4-IL)ETOXI)-1H-INDAZOL-3-IL)VINIL)-1H-PIRAZOL-1-IL)ETANOL CRISTALINO”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar agentes inhibidores de FGFR útiles en el tratamiento del cáncer.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un sólido cristalino del compuesto ((R)-(E)-2.(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/14; A61K 31/4439, A61P 35/00.

5. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 y 2 carecen de una caracterización adecuada del sólido cristalino, que permita establecer de manera clara el alcance de la solicitud e identificar de forma inequívoca el producto reclamado. Un polimorfo se puede caracterizar apropiadamente en una reivindicación, por sus parámetros fisicoquímicos, tales como:

1. El patrón de difracción de Rayos X en mono cristal, que es específico de cada polimorfo, por lo cual, si la reivindicación caracteriza el polimorfo mediante este patrón, no se exigirá otro dato.
2. El patrón de difracción de Rayos X en polvo (DRXP), el cual debe presentar por lo menos 20 picos correspondientes a las intensidades de los haces difractados o a los espacios interplanares d_{hkl} según los índices de Miller (hkl) medidos de acuerdo con el ángulo de difracción de Bragg 2θ en el intervalo más representativo comprendido entre 5° hasta 90° .
3. Las espectroscopías Raman e IR.
4. La espectroscopía RMN- C^{13}
5. Los métodos de análisis térmico: TGA, DTA y DSC.

Es pertinente señalar que un pico del espectro de difracción de rayos X es insuficiente para caracterizar de manera inequívoca un sólido cristalino de un compuesto dado. Esto es evidenciado por Bhattacharya¹ que provee un gráfico

1. H.G. Brittain. “Polymorphism in Pharmaceutical Solids”. Segunda Edición, Informa Healthcare, NY, 2009. Págs. 334 y 335.

(fig. 11) en el cual superpone los difractogramas XRPD de dos polimorfos de ibandronato sódico. A través de esto Bhattacharya *et al.*, demuestran que diferentes polimorfos de un compuesto dado pueden compartir incluso tres picos principales de XRPD. De acuerdo con Bhattacharya, alrededor de diez de los picos más fuertes del XRPD son necesarios para identificar una forma cristalina única. En consecuencia, dos picos de XRPD son insuficientes para caracterizar inequívocamente un polimorfo.

Las reivindicaciones 1 y 2 carecen de concisión y sustento descriptivo, toda vez que abarcan cualquier forma cristalina existente y que pueda desarrollarse en el futuro del compuesto ((R)-(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol o su solvatomorfo. Sin embargo, la descripción tan solo demuestra la existencia y obtención de una sola forma monohidrato de este compuesto, debido a que sólo se proporciona el listado de los picos característicos del difractograma de rayos X del compuesto del ejemplo 1 (Tabla 1). No existe información en la solicitud que demuestre la existencia de otras formas cristalinas del compuesto en su forma monohidrato o anhidra.

La reivindicación 3 caracteriza el compuesto por ser aislado. El aislamiento es una etapa de un proceso de cristalización o purificación y no se considera un elemento técnico característico de un producto.

6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de patente: 8 de abril de 2013, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Radicación
D1	CO-11-150245	"(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-DICLOROPIRIDIN-4-IL) ETOXI)-1H-INDAZOL-3-IL) VINIL)-1H-PIRAZOL-1-IL) ETANOL O UNA SAL FARMACEÚTICAMENTE ACEPTABLE DEL MISMO, COMO INHIBIDOR DE FGFR"	4/noviembre/2011

El documento D1² divulga el compuesto ((R)-(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol, cuyo proceso de fabricación incluye una recristalización del producto en acetato de etilo caliente/metanol/hexanos para producir el compuesto como un sólido blanco (Págs. 14 y 15).

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

Las reivindicaciones 1 y 2 consisten en sólidos cristalinos del compuesto ((R)-(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol

²http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2007126957&KC=&locale=en_EP&FT=E

Características esenciales	D1
Reiv 1: Un compuesto caracterizado porque es ((R)-(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol cristalino.	El compuesto ((R)-(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol obtenido mediante recristalización del producto en acetato de etilo caliente/metanol/hexanos para producir el compuesto como sólido blanco (Págs. 14 y 15).
Reiv. 2: El compuesto caracterizado porque es monohidrato de ((R)-(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol cristalino.	

Las características esenciales del sólido cristalino de las reivindicaciones 1 y 2 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, el cual enseña el compuesto ((R)-(E)-2-(4-(2-(5-(1-(3,5-dicloropiridin-4-il)etoxi)-1H-indazol-3-il)vinil)-1H-pirazol-1-il)etanol, el cual es un cristal obtenido mediante un proceso de recristalización que da lugar a un sólido blanco (Págs. 14 y 15). Toda vez que las reivindicaciones no especifican ninguna característica técnica del sólido reclamado, se considera que el producto divulgado en D1 se encuentra comprendido dentro del alcance de las reivindicaciones 1 y 2.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 y 2 no son nuevas, según lo divulgado en el documento D1.

La composición de la reivindicación 8 se encuentra divulgada previamente en D1 y carece de novedad (Reiv. 3)

8. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO-11-150245	1, 2 y 8	Novedad

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir del día siguiente de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2014-08-19

Elaboró: Emilse Cano Urrego
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo